

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2005 年 1 月 6 日 (06.01.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/000778 A1

(51) 国際特許分類: C07C 49/84, 69/738, 235/78, 205/45, C07D 207/12, 211/42, 211/22, 211/60, 295/12, 295/08, 207/12, 207/27, 213/50, 239/42, 295/18, 211/62, 211/52, 211/54, 211/58, 213/40, A61K 31/5375, 31/40, 31/4406, 31/4409, 31/12, 31/165, 31/216, 31/506, 31/495, 31/445, 31/451, 31/5377, A61P 43/00, 35/00

(KAJITA, Jiro). 齋藤 純一 (SAITO, Jun-ichi). 塩津 行正 (SHIOTSU, Yukimasa). 秋永 士朗 (AKINAGA, Shiro).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/008494

(22) 国際出願日: 2004 年 6 月 10 日 (10.06.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2003-185475 2003 年 6 月 27 日 (27.06.2003) JP

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 協和酸酵工業株式会社 (KYOWA HAKKO KOGYO CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1008185 東京都千代田区大手町一丁目 6 番 1 号 Tokyo (JP).

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(72) 発明者; および

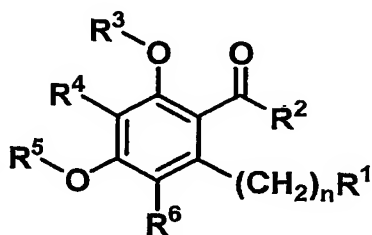
添付公開書類:
— 国際調査報告書

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 奈良 真二 (NARA, Shinji). 中川 啓 (NAKAGAWA, Hiroshi). 神田 裕 (KANDA, Yutaka). 中嶋 孝行 (NAKASHIMA, Takayuki). 曽我 史朗 (SOGA, Shiro). 梶田 治郎

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: Hsp90 FAMILY PROTEIN INHIBITORS

(54) 発明の名称: Hsp90 ファミリー蛋白質阻害剤



(I)

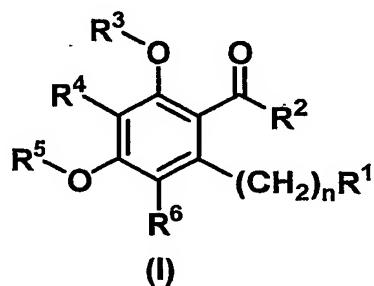
(57) Abstract: Hsp90 family protein inhibitors containing as the active ingredient benzoyl compounds represented by the general formula (I), prodrugs thereof, or pharmacologically acceptable salts of both: (I) wherein n is an integer of 1 to 10; R¹ is substituted or unsubstituted lower alkoxy, substituted or unsubstituted lower alkoxy carbonyl, CONR⁷R⁸, or the like; R² is substituted or unsubstituted aryl, a substituted or unsubstituted aromatic heterocyclic group, or the like; R³ and R⁵ are each independently hydrogen, substituted or unsubstituted lower alkyl, substituted or unsubstituted lower alkenyl, or the like; and R⁴ and R⁶ are each independently hydrogen, halogeno, substituted or unsubstituted lower alkyl, substituted or unsubstituted aryl, or the

like.



(57) 要約:

一般式(I)



(式中、 n は 1~10 の整数を表し、 R^1 は置換もしくは非置換の低級アルコキシ、置換もしくは非置換の低級アルコシカルボニル、 $CONR^7R^8$ などを表し、 R^2 は置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換の芳香族複素環基などを表し、 R^3 および R^5 は同一または異なって、水素原子、置換もしくは非置換の低級アルキル、置換もしくは非置換の低級アルケニルなどを表し、 R^4 および R^6 は同一または異なって、水素原子、ハロゲン、置換もしくは非置換の低級アルキル、置換もしくは非置換のアリールなどを表す) で表されるベンゾイル化合物もしくはそのプロドラッグまたはそれらの薬理的に許容される塩を有効成分として含有する Hsp90 ファミリー蛋白質阻害剤を提供する。